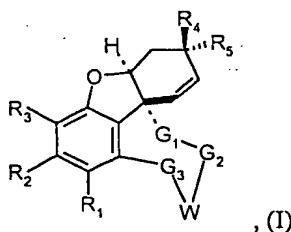


Claims:

1. New compounds of general formula I



in which the substituents have the meanings that are explained below:

R₁ and R₂ are the same or different and mean:

a) hydrogen, F, Cl, Br, I, CN, NC, OH, SH, NO₂, SO₃H, PO₃H, NH₂, CF₃, OSO₂(CH₂)_nCF₃, in which n is equal to 0, 1 or 2, -OSO₂-aryl, -OSO₂-vinyl or -OSO₂-ethinyl;

b) a low (C₁-C₆), optionally branched, optionally substituted (Ar)alkyl, (Ar)alkoxy, cycloalkyl or cycloalkoxy group;

c) an amino group, which optionally is substituted by one or two identical or different low (C₁-C₆), optionally branched, optionally substituted (Ar)alkyl or (Ar)alkylcarbonyl or (Ar)alkoxycarbonyl groups or by a group that is selected from an optionally substituted pyrrolidine, piperidine, morpholine, thiomorpholine, piperazine, or homopiperazine radical;

d) a -COOH, -COO(Ar)alkyl, -CO-amino group, which optionally is substituted as indicated under c), or a COH(Ar)alkyl group;

e) a $-(CH_2)_nX$ (in which $X = Br, Cl, F$ or I), $-(CH_2)_nOH$, $-(CH_2)_nCHO$, $-(CH_2)_nCOOH$, $-(CH_2)_nCN$, $-(CH_2)_nNC$, $-(CH_2)_nCOalkyl$, or $-(CH_2)_nCOaryl$ group, in which n is 1-4;

f) a $-(CH_2)_n$ vinyl, $-(CH_2)_n$ ethinyl, or $-(CH_2)_n$ cycloalkyl group in which n is 0, 1 or 2, whereby cycloalkyl is an aliphatic ring with 3 to 7 C atoms;

g) a C_3 - C_6 -substituted alkenyl group (optionally substituted with H, F, Br, Cl, CN, CO_2alkyl , $COalkyl$, $COaryl$);

h) a C_3 - C_6 -substituted alkynyl group (optionally substituted with H, F, Br, Cl, CN, CO_2alkyl , $COalkyl$, $COaryl$); or

i) R^1 and R^2 together mean $-CH=CH-CH=CH-$, $-O(CH_2)_nO-$ ($n = 1$ to 3), $-CH=CHA_1-$ (A_1 is NH, O or S), or $-CH_2CH_2-A_1$ (A_1 is NH, O or S);

R_3 has the same meaning as R_1 , especially OH and OCH_3 , or

R_2 and R_3 together mean $-A_2(CH_2)_nA_2-$, in which n is 1 to 3 and substituents A_2 are the same or different and mean NH, O or S;

R_4 and R_5 are either

a) both hydrogen,

or

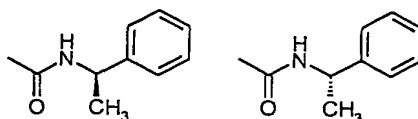
b) one of R_4 and R_5 is hydrogen, an (Ar)alkyl, (Ar)alkenyl or (Ar)alkynyl group, and the other of R_4 and R_5 is

i) OR_6 , in which R_6 means hydrogen, a low (C_1 - C_{10} , optionally branched or substituted) alkyl group or cycloalkyl group, a C_3 - C_{10} substituted silyl group (for example, triethylsilyl, trimethylsilyl, t-butyldimethylsilyl or dimethylphenylsilyl), a C_2 - C_{10} alpha-alkoxyalkyl group, for example tetrahydropyranyl, tetrahydrofuranyl,

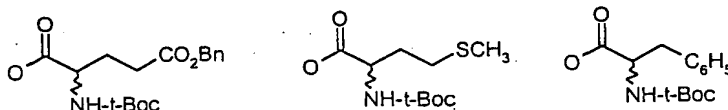
methoxymethyl, ethoxymethyl, 2-methoxypropyl, ethoxyethyl, phenoxyethyl or 1-phenoxyethyl;

ii) $O-CS-NHR_6$ (thiourethane), in which R_6 has the meanings indicated above under i);

iii) $O-CO-NHR_7$ with the meaning below:



iv) $O-CO-HR_6$, in which R_6 has the meanings indicated above under i), especially ester with the substitution pattern of amino acids (both enantiomers), such as



v) NR_7R_7 , in which two substituents R_7 are the same or different and mean hydrogen, a low (C_1-C_4), optionally branched, alkyl group or cycloalkyl group, or substituents R_7 together are $-(CH_2)_n$, in which n is 3 to 5;

vi) $NH-COR_6$ (amide), in which R_6 has the meanings indicated above under i);

vii) $S-R_6$, in which R_6 has the meaning indicated above under i);

viii) SO_nR_8 , in which n is 0, 1 or 2, and in which R_8 is a $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$, optionally branched or cyclic, optionally substituted (Ar)alkyl group;

$\underline{\text{G}}_1$: $-(\text{CH}_2)_x-$, in which x is 1 or 2;

5 $\underline{\text{G}}_2$: $-(\text{CH}_2)_y-$, in which y is 0 to 2;

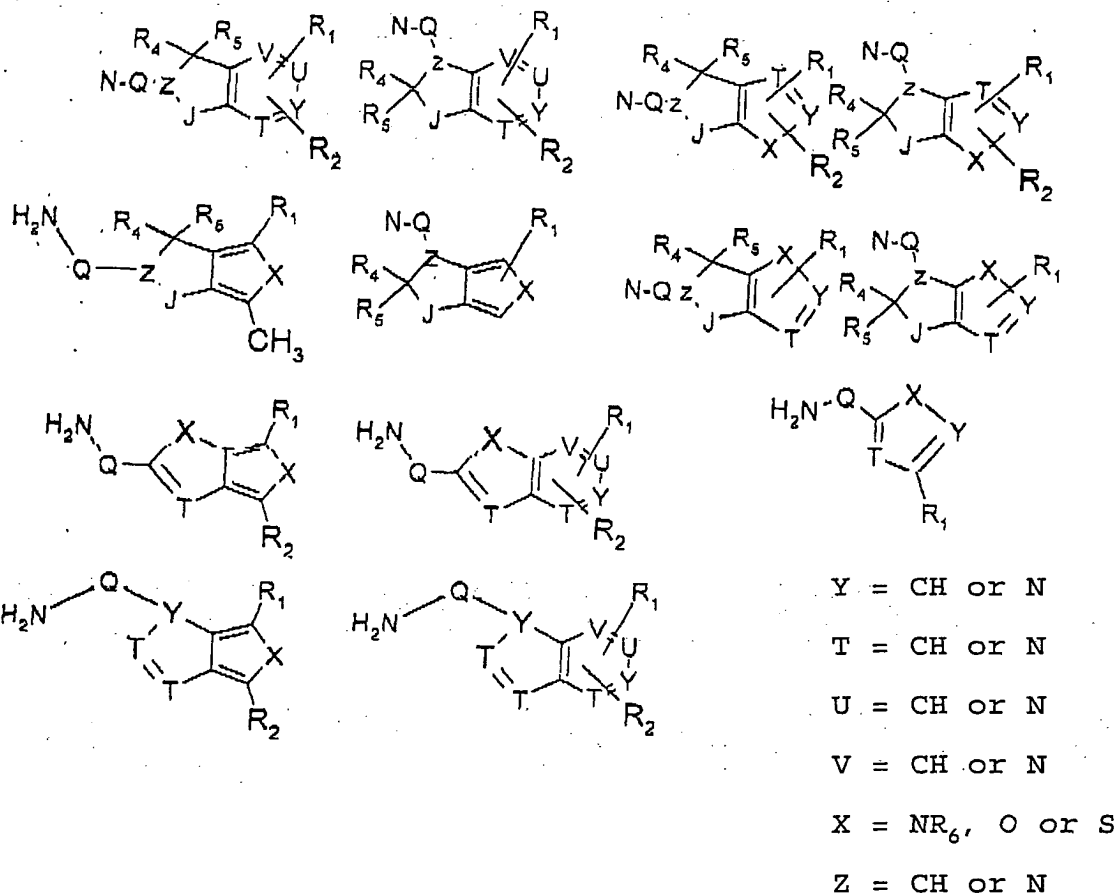
$\underline{\text{G}}_3$: $-(\text{CH}_2)_z-$, in which z is 0 to 3, provided that the sum of $x+y+z$ is at least 2 and at most 4, or in which $\underline{\text{G}}_3$ is carbonyl or thiocarbonyl, $-\text{CH}(\text{OH})-$ or $-\text{C}(\text{OH})=$;

$\underline{\text{W}}$ is:

10 a) $\text{CR}_{13}\text{R}_{14}$, in which R_{13} means hydrogen and R_{14} means $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}_7\text{R}_7$, $-\text{CO}-\text{NR}_7\text{R}_7$ or $-\text{COOR}_7$, in which n is 0 to 2 and R_7 has the above-mentioned meanings, or R_7 and R_7 form a ring via $-(\text{CH}_2)_n-$, in which n is 3 to 5, whereby substituents R_{13} and R_{14} can be exchanged;

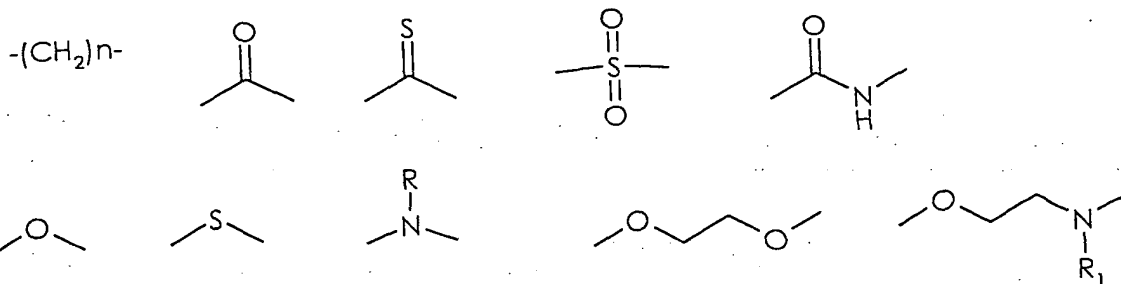
15 b) N-Phenyl (optionally substituted with fluorine, bromine, chlorine, $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ alkyl, CO_2 alkyl, CN , CONH_2 , or alkoxy) means N-thien-2 or 3-yl, or N-fur-2 or 3-yl or an N-1,3,5-triazinyl, whereby the triazine radical can then be substituted with Cl , OR_6 or NR_7R_7 , and R_6 or R_7 has the meaning indicated above;

c) One of the substituents that is presented below

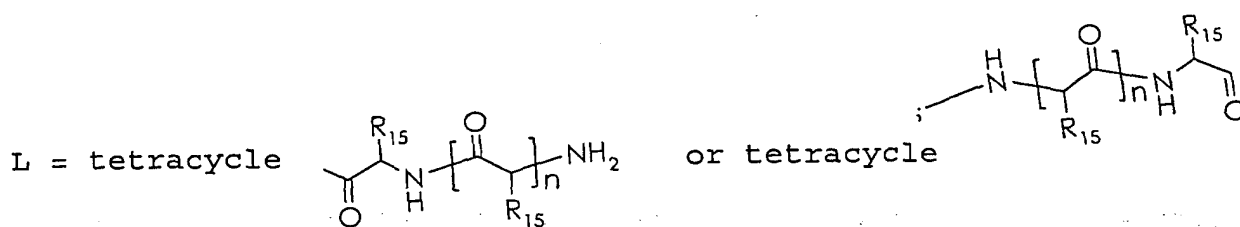


in which I means no bond or $-(CH_2)_n-$, whereby $n = 0$ to 3 ,

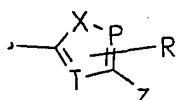
carbonyl, thiocarbonyl, O, S, $-SO-$ or SO_2 , R_6 has the meanings that are indicated above, and in which, Q is $-(CH_2)_n-M^*-(CH_2)_m$, whereby $n = 0$ to 4 and $m = 0$ to 4 and M^* means alkynyl, alkenyl, disubstituted phenyl, disubstituted thiophene, disubstituted furan, disubstituted pyrazine, disubstituted pyridazine, a spacer of one of the formulas presented below, a peptide spacer L or a heterocyclic spacer HS of the formulas below,



5



HS = tetracycle



P = CH or N

T = CH or N

X = NR_6 , O or S

Z = CH or N

15

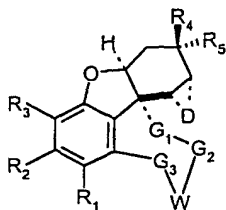
in which R_{15} means the side chain of D-, L-, D,L-amino acids or
 20 unnatural amino acids, and for the case of $n > 1$, R_{15} in the
 individual radicals in each case means the same or a different
 side chain of D-, L-, D,L-amino acids or unnatural amino acids,
 provided that atom N in addition to Q is connected in each case
 to groups G2 and G3 of formula I;

25 d) a tricyclic substituent (Tr) that is optionally
 substituted at least in one place with at least one heterocyclic
 ring as a ring component and a binding site to a carbon atom of

an anellated benzene ring thereof, which is connected via a spacer Q and the nitrogen atom that is adjacent to Q in each case with G₂ and G₃ of the compound of formula I, whereby Q has the meaning that is indicated above under c); or

5 e) -NH-, -O-, -S-, -SO- or -SO₂-.

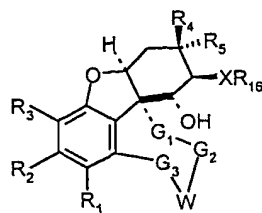
2. New compounds of general formula II



(II)

10 in which D means N-H, N-alkyl, N-acyl, oxygen or sulfur, and in which substituents R₁ to R₅, G₁ to G₃ and W have the meanings that are indicated in claim 1 in general formula I.

3. New compound of general formula III

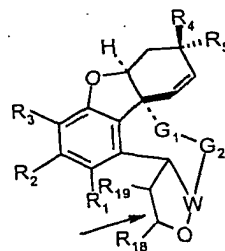


(III)

20 in which X-R₁₆ is a substituent, in which X is oxygen or sulfur and R₁₆ is hydrogen or a low (C₁-C₁₀), optionally branched, optionally substituted (Ar)alkyl group, and in which substituents

R_1 to R_5 , G_1 to G_3 and W have the meanings that are indicated in general formula I.

4. New compound of general formula IV



single or
double bond

(IV)

in which R_{18} and R_{19} mean hydrogen, alkyl, aryl or aralkyl, and in which the C atoms that carry substituents R_{18} and R_{19} are linked to one another via a single bond or a double bond, and in which substituents R_1 to R_5 and G_1 and G_3 have the meanings that are indicated in general formula I, whereby W means CH or N.

5. Compound according to one of claims 1 to 4, in which substituent R_6 means a triethylsilyl, trimethylsilyl, t-butyl dimethylsilyl or dimethylphenylsilyl.

6. Compound according to one of claims 1 to 4, in which substituent R_6 means tetrahydropyranyl, tetrahydrofuranyl, methoxymethyl, ethoxymethyl, (2-methoxypropyl), ethoxyethyl, phenoxymethyl or (1-phenoxyethyl).

7. Compound according to one of claims 1 to 4, in which R_4 is hydrogen, and R_5 is OH, CN, CO_2 -alkyl, CONR_aR_b , in which R_a is hydrogen, a low (C_1 - C_6), optionally branched, cyclic, substituted alkyl group, and R_b is hydrogen, a low (C_1 - C_6), optionally

branched or substituted alkyl group, or $R_a + R_b$ together are -

$(CH_2)_n-$, in which n means 2 to 6, or

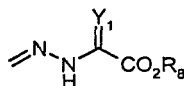
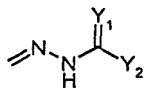
$-(CH_2)_n E (CH_2)_n-$, in which E is the same as NH, N-alkyl, O, or S, and n is 0 to 5, aryl (phenyl or naphthyl), or a 6- heterocycle.

8. Compound according to claim 7, in which the 6- heterocycle is imidazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, triazolyl, tetrazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl and substituted variants thereof, imidazoliny, thiazoliny or oxazoliny.

9. Compound according to one of claims 1 to 8, in which R_5 has a meaning other than hydrogen, and R_4 is OH.

10. Compound according to one of claims 1 to 9, in which R_4 and R_5 together are carbonyl ($=O$), hydrazone ($=N-NH-R_9$, $=N-NR_9R_{10}$) or oxime ($=N-OR_{10}$), in which R_9 is hydrogen, a low (C_1-C_6), optionally branched or cyclic, optionally substituted (Ar)alkyl- or (Ar)alkylcarbonyl-, (Ar)alkylcarbonyloxy group or a sulfonic acid group, such as tosyl or mesyl, and R_{10} is hydrogen, a low (C_1-C_6), optionally branched or cyclic, optionally substituted (Ar)alkyl- or (Ar)alkylcarbonyl group, a sulfonic acid group, such as a tosyl group or mesyl group.

11. Compound according to one of claims 1 to 4, in which R_4 and R_5 together are substituents of the type



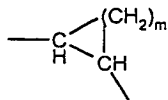
in which Y_1, Y_2 are the same or different and mean O, S, NH or N-
 R_9 (free valences are in any case hydrogen), in which R_9 has the
 meanings that are mentioned in claim 10.

12. Compound according to claim 11, in which Y_1 is NH and
 Y_2 is N- R_9 , and in which R_4 and R_5 are connected by $-(CH_2)_n-$ ($n =$
 2, 3, or 4).

13. Compound according to one of claims 1 to 12, in which
 G_1 and G_2 together or separately mean:

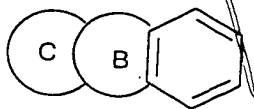
$-C(R_{11} R_{12})-$, in which R_{11} and R_{12} mean hydrogen, OH, a low,
 optionally branched or cyclic, optionally substituted (Ar)alkyl,
 aryl, (Ar)alkyloxy or aryloxy group or together an alkylspiro
 group (C_3 - C_7 spiro ring).

14. Compound according to one of claims 1 to 13, in which
 G_1 and G_2 together mean

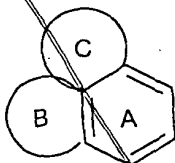


in which m is 1 to 7.

15. Compound according to one of claims 1 to 14, in which
 tricyclic substituent Tr is a condensed benzene ring of general
 formula

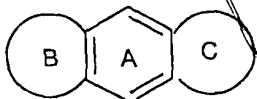


or



5

or



10

16. Compound according to claim 15, in which ring A is a substituted benzene ring.

15

17. Compound according to claim 15 or 16, in which one of rings B and C is an optionally substituted heterocyclic ring and the other is a substituted ring that can contain one or more heteroatoms in the ring.

20

18. Compound according to one of claims 15 to 17, in which the benzene ring is substituted in at least one place, whereby these substituents are halogens, such as fluorine and chlorine, halo-C₁-C₃ alkyl groups, such as trifluoromethyl, C₁-C₃ alkyl groups, such as methyl, C₁-C₃ alkoxy groups, such as methoxy, and the hydroxy group, especially a halogen, such as fluorine.

25

19. Compound according to one of claims 15 to 18, in which the optionally substituted heterocyclic ring B or C is a 4- to 14-membered ring, preferably a 5- to 7-membered ring, especially

4 a 5- to 7-membered, nonaromatic ring, which contains one or two identical or different heteroatoms.

20. Compound according to claim 19, in which at least one heteroatom of the heterocyclic ring (1 to 3 heteroatoms are 5 possible) is nitrogen, oxygen, or sulfur.

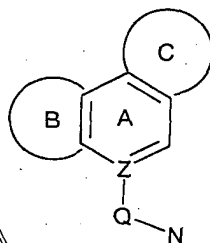
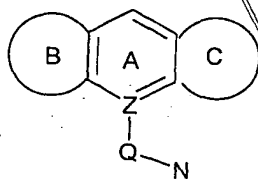
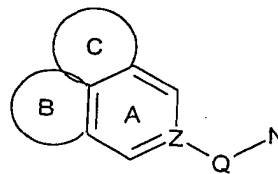
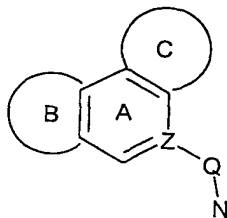
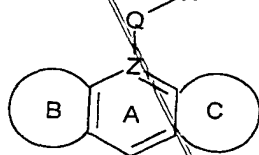
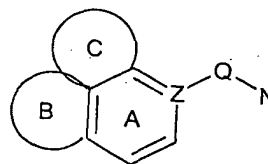
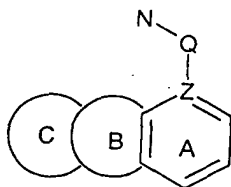
21. Compound according to claim 20, in which heterocyclic ring B or C is pyridine, pyrazine, pyrimidine, imidazole, furan, thiophene, pyrrolidine, piperidine, hexamethylenimine, tetrahydrofuran, piperazine, morpholine or thiomorpholine.

10 22. Compound according to one of claims 15 to 21, in which the 5- to 8-membered ring B or C is a 5- to 8-membered heterocyclic or alicyclic ring, or a carbon ring that is substituted at least in one place.

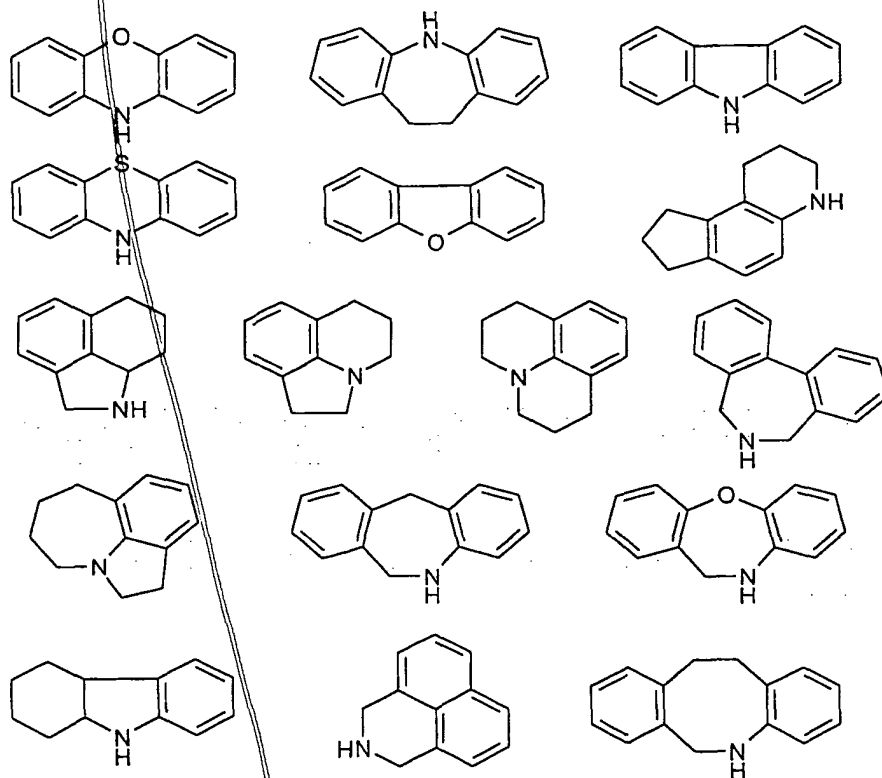
15 23. Compound according to claim 22, in which the 5- to 8-membered carbon ring is a benzene ring or a saturated or unsaturated ring, for example, benzene, cyclopentane, cyclopentene, cyclohexane, cyclohexene, cyclohexadiene, cycloheptane, cycloheptene and cycloheptadiene.

24. Compound according to one of claims 1 to 23, in which tricyclic substituent Tr is a group from one of the formulas that

5



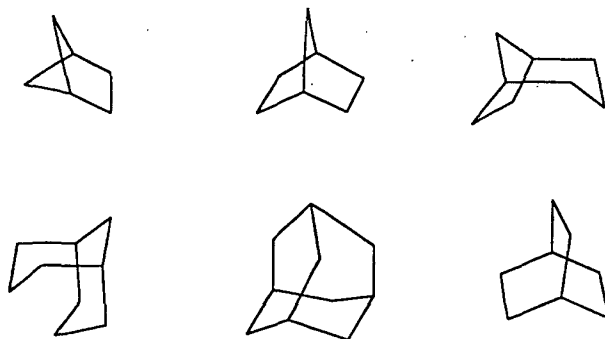
25. Compound according to one of claims 1 to 23, in which tricyclic substituent Tr is a group from one of the formulas that is presented below



25

26. Compound according to one of claims 1 to 25, in which Tr is a cyclic or bicyclic hydrocarbon.

27. Compound according to claim 26, in which Tr has one of the formulas below:



28. Compound according to one of claims 1 to 27, in which substituent Tr is substituted at least in one place with R_1 , and R_1 has the meanings indicated in claim 1.

29. Compound according to one of claims 1 to 28, in which substituent W is nitrogen and/or substituent G_1 is $-(CH_2)_x-$, in which x is equal to 1 or 2 and G_2 means $-(CH_2)_y-$, in which y is equal to 0 to 2, provided that x + y together mean at least 2 and at most 4.

30. Compound according to one of claims 1 to 29, in which substituents G_1 and G_2 together or separately have the meaning of $-CR_{11}R_{12}-$, in which R_{11} and R_{12} mean hydrogen, hydroxy, a low, optionally branched or cyclic, optionally substituted (Ar)alkyl, aryl, (Ar)alkoxy or aryloxy group.

31. Compound according to one of claims 1 to 30, in which G_1 and G_2 together are an alkylspiro group (C_3 - C_7 spiro ring).

32. Process for the production of the compounds of claims 1 to 31, characterized in that the combinatorial or parallel-synthesis technology is used, whereby the basic molecule is immobilized by a functional group (linker) in a solid phase, which implements the synthesis of the target compound and then this target compound is separated from the solid phase.

33. Process according to claim 32, wherein the basic molecule is immobilized in the solid phase via a carbon center, a nitrogen center or an oxygen center.

34. Process according to claim 32 or 33, wherein $-X(CH_2)_nCO$ ($X = CH_2, CO, O, S, NH$), $-X(CH_2)_nOCO$ ($X = CH_2, CO, O, S, NH$), $-XC_6H_4CH_2-$ ($X = CH_2, CO, O, S, NH$), THP, or $-X(CH_2)_nSi(alkyl)_2$ is used as a functional group (linker).

35. Process according to claim 32 or 33, wherein $-X(CH_2)_nCO$ ($X = CH_2, O, NH, SO_{0-2}$), $-X(CH_2)_nCS$ ($X = CH_2, O, NH, SO_{0-2}$), $X(CH_2)_nJCO$ ($X = CH_2, O, NH, SO_{0-2}$; $J = NH, O, S$), or $XC_6H_4CH_2$ ($X = CH_2, O, S$) is used as a functional group (linker).

36. Process according to claim 32 or 33, wherein $-(CH_2)_nSi(alkyl)_2-$, $-C_6H_4Si(alkyl)_2-$, $-(CH_2)_nSn(alkyl)_2-$, $-C_6H_4Sn(alkyl)_2$, $-(CH_2)_nS$, or $-C_6H_4S$ is used as a functional group (linker).

37. Pharmaceutical agent that contains at least one of the compounds of general formulas I, II, III or IV, or a pharmaceutically acceptable salt thereof as an active ingredient.

38. Use of at least one of the compounds of general formulas I, II, III or IV, or a pharmaceutically acceptable salt thereof for the production of pharmaceutical agents.

5

項目	1990年	1991年	1992年	1993年	1994年	1995年	1996年	1997年	1998年	1999年	2000年	2001年	2002年	2003年	2004年	2005年	2006年	2007年	2008年	2009年	2010年	2011年	2012年	2013年	2014年	2015年	2016年	2017年	2018年	2019年	2020年	2021年	2022年	2023年	2024年	2025年	2026年	2027年	2028年	2029年	2030年	2031年	2032年	2033年	2034年	2035年	2036年	2037年	2038年	2039年	2040年	2041年	2042年	2043年	2044年	2045年	2046年	2047年	2048年	2049年	2050年	2051年	2052年	2053年	2054年	2055年	2056年	2057年	2058年	2059年	2060年	2061年	2062年	2063年	2064年	2065年	2066年	2067年	2068年	2069年	2070年	2071年	2072年	2073年	2074年	2075年	2076年	2077年	2078年	2079年	2080年	2081年	2082年	2083年	2084年	2085年	2086年	2087年	2088年	2089年	2090年	2091年	2092年	2093年	2094年	2095年	2096年	2097年	2098年	2099年	2100年	2101年	2102年	2103年	2104年	2105年	2106年	2107年	2108年	2109年	2110年	2111年	2112年	2113年	2114年	2115年	2116年	2117年	2118年	2119年	2120年	2121年	2122年	2123年	2124年	2125年	2126年	2127年	2128年	2129年	2130年	2131年	2132年	2133年	2134年	2135年	2136年	2137年	2138年	2139年	2140年	2141年	2142年	2143年	2144年	2145年	2146年	2147年	2148年	2149年	2150年	2151年	2152年	2153年	2154年	2155年	2156年	2157年	2158年	2159年	2160年	2161年	2162年	2163年	2164年	2165年	2166年	2167年	2168年	2169年	2170年	2171年	2172年	2173年	2174年	2175年	2176年	2177年	2178年	2179年	2180年	2181年	2182年	2183年	2184年	2185年	2186年	2187年	2188年	2189年	2190年	2191年	2192年	2193年	2194年	2195年	2196年	2197年	2198年	2199年	2200年	2201年	2202年	2203年	2204年	2205年	2206年	2207年	2208年	2209年	2210年	2211年	2212年	2213年	2214年	2215年	2216年	2217年	2218年	2219年	2220年	2221年	2222年	2223年	2224年	2225年	2226年	2227年	2228年	2229年	2230年	2231年	2232年	2233年	2234年	2235年	2236年	2237年	2238年	2239年	2240年	2241年	2242年	2243年	2244年	2245年	2246年	2247年	2248年	2249年	2250年	2251年	2252年	2253年	2254年	2255年	2256年	2257年	2258年	2259年	2260年	2261年	2262年	2263年	2264年	2265年	2266年	2267年	2268年	2269年	2270年	2271年	2272年	2273年	2274年	2275年	2276年	2277年	2278年	2279年	2280年	2281年	2282年	2283年	2284年	2285年	2286年	2287年	2288年	2289年	2290年	2291年	2292年	2293年	2294年	2295年	2296年	2297年	2298年	2299年	2300年	2301年	2302年	2303年	2304年	2305年	2306年	2307年	2308年	2309年	2310年	2311年	2312年	2313年	2314年	2315年	2316年	2317年	2318年	2319年	2320年	2321年	2322年	2323年	2324年	2325年	2326年	2327年	2328年	2329年	2330年	2331年	2332年	2333年	2334年	2335年	2336年	2337年	2338年	2339年	2340年	2341年	2342年	2343年	2344年	2345年	2346年	2347年	2348年	2349年	2350年	2351年	2352年	2353年	2354年	2355年	2356年	2357年	2358年	2359年	2360年	2361年	2362年	2363年	2364年	2365年	2366年	2367年	2368年	2369年	2370年	2371年	2372年	2373年	2374年	2375年	2376年	2377年	2378年	2379年	2380年	2381年	2382年	2383年	2384年	2385年	2386年	2387年	2388年	2389年	2390年	2391年	2392年	2393年	2394年	2395年	2396年	2397年</
----	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	-------	---------